

AEROSOL COMPOSITION FOR ANTI-INFLAMMATORY

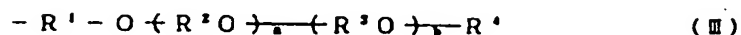
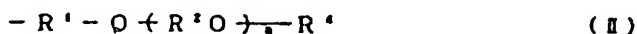
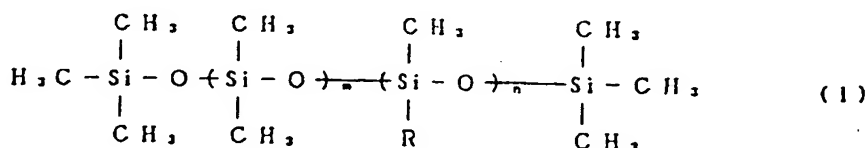
Patent number: JP63264522
 Publication date: 1988-11-01
 Inventor: SHINOSAWA TAKAHIRO
 Applicant: TOYO AEROSOL IND CO
 Classification:
 - international: A61K9/12; A61K31/08
 - european:
 Application number: JP19870097537 19870422
 Priority number(s): JP19870097537 19870422

Report a data error here

Abstract of JP63264522

PURPOSE: To obtain the titled composition consisting of a dope containing lambda-1,3-menthoxypropane-1,2-diol, hydrophilic polyether modified silicone, etc. and propellant, free from stimulating odor, comfortably usable and having good bonding to a human body by drug active ingredient. **CONSTITUTION:** An aerosol composition consisting of a dope containing (A) 2-30wt.% 1-1,3-menthoxypropane 1,2-diol exhibiting excellent anti-inflammatory effect (B) 1-40wt.% adhesion improving agent composed of a hydrophilic polyether modified silicone, preferably a compound expressed by formula I [m and n are 3-10; R is formula II or formula III (R<1> is 1-12C aliphatic hydrocarbon group; R<2> and R<3> are 1-5C aliphatic hydrocarbon group; R<4> is 1-20C aliphatic hydrocarbon group; a is 3-30; b is 15-30)], (C) 25-40wt.% alcohol and (D) 20-40wt.% water and propellant. The composition can be stably used over long term without accompanying filling of packing vessel and occurrence of aggregate, because the component B has high solubility to components C and D.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide



BEST AVAILABLE COPY

THIS PAGE BLANK (USPTO)

BEST AVAILABLE COPY

⑫ 公開特許公報(A)

昭63-264522

⑤ Int.Cl.⁴A 61 K 31/08
9/12

識別記号

A A H
A B E

庁内整理番号

7330-4C
E-6742-4C

④ 公開

昭和63年(1988)11月1日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑬ 発明の名称 消炎鎮痛剤用エアゾール組成物

⑭ 特 願 昭62-97537

⑮ 出 願 昭62(1987)4月22日

⑯ 発 明 者 篠 沢 孝 紘 東京都大田区中央6-20-21

⑰ 出 願 人 東洋エアゾール工業株 東京都千代田区内幸町1丁目3番1号
式会社

⑱ 代 理 人 弁理士 大井 正彦

明 細 書

1. 発明の名称

消炎鎮痛剤用エアゾール組成物

2. 特許請求の範囲

1) 下記成分①乃至④を必須成分として含有してなる原液と、噴射剤とよりなることを特徴とする消炎鎮痛剤用エアゾール組成物。

成分①: 1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオールよりなる薬効成分

成分②: 親水性ポリエーテル変成シリコンよりなる付着性向上剤

成分③: アルコール

成分④: 水

3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

本発明は、人体に使用される消炎鎮痛剤用エアゾール組成物に関するものである。

(発明の背景)

消炎鎮痛剤用エアゾール組成物は、通常、薬効成分が含有されてなる原液と、噴射剤とにより構

成されてなる。

従来、薬効成分として、1-メントールが用いられた消炎鎮痛剤用エアゾール組成物が知られている(特開昭56-135414号、特開昭61-209288号公報参照)。

(発明が解決しようとする問題点)

しかしながら、1-メントールは刺激臭を有しているため、人体の鼻、のど、目等を刺激し、不快感を与える問題点がある。

また、薬効成分の人体に対する付着性を改善するために、通常、粉末材料を原液に含有させることが行われているが、原液が水を含有してなるいわば水溶性のものである場合には、エアゾール組成物の充填用容器の目詰まりを起こし、あるいは凝集物が発生する等の問題点が生ずる。

(発明の目的)

本発明は以上の如き事情に基いてなされたものであって、その目的は、刺激臭がなくて快適に使用することができ、しかも薬効成分の人体に対する付着性が良好な消炎鎮痛剤用エアゾール組成物

を提供することにある。

〔問題点を解決するための手段〕

本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物は、下記成分①乃至④を必須成分として含有してなる原液と、噴射剤とよりなることを特徴とする。

成分①： ℓ -1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオールよりなる薬効成分

成分②：親水性ポリエーテル変成シリコンよりなる付着性向上剤

成分③：アルコール

成分④：水

〔発明の作用効果〕

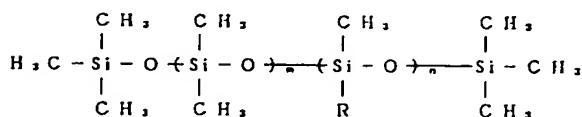
本発明によれば、 ℓ -1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオールよりなる薬効成分を用いるので、刺激臭がなく、従って人体の鼻、のど、目等を刺激するようなおそれがなく快適に使用することができ、しかも親水性ポリエーテル変成シリコンよりなる付着性向上剤を用いるので、当該親水性ポリエーテル変成シリコンは水およびアルコールに対する溶解性が高く、そのためエアゾール

成分②が含有される。この付着性向上剤は、薬効成分の人体の皮膚等に対する付着性を向上させるためのものである。

この親水性ポリエーテル変成シリコンは、水およびアルコールに対する溶解性が高く、エアゾール組成物の充填用容器の目詰まり、凝集物の発生するおそれがないうえ、 ℓ -1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオールよりなる薬効成分の人体の皮膚等に対する付着性を向上させることができ、優れた消炎鎮痛効果が得られる。この親水性ポリエーテル変成シリコンの原液における含有割合は、1~40重量%程度であることが好ましく、特に好ましくは5~15重量%程度である。

斯かる親水性ポリエーテル変成シリコンとしては、例えば下記一般式(I)で示される構造を有するものを好ましく用いることができる。

一般式(I)



特開昭63-264522(2) ;

組成物の充填用容器の目詰まり、凝集物の発生を伴うことなく長期間にわたり安定に使用することができるうえ、薬効成分の人体の皮膚等に対する付着性が向上して、優れた消炎鎮痛効果が発揮される。

〔発明の具体的構成〕

以下、本発明の具体的構成について説明する。

本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物を構成する原液には、第1の必須成分として ℓ -1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオールよりなる薬効成分(成分①)が含有される。この ℓ -1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオールは、刺激臭がないうえ、優れた消炎鎮痛効果を発揮するものである。この ℓ -1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオールの原液における含有割合は、2~30重量%程度であることが好ましく、特に好ましくは5~15重量%程度である。

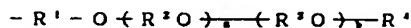
本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物を構成する原液には、第2の必須成分として親水性ポリエーテル変成シリコンよりなる付着性向上剤(成

(mおよびnはそれぞれ3~10の整数を表し、

Rは、



または



を表す。

ただし、 R^1 は炭素数1~12の脂肪族炭化水素基(例えば C_2H_5 等)を表し、 R^2 は炭素数1~5の脂肪族炭化水素基(例えば C_2H_5 等)を表し、 R^3 は炭素数1~5の脂肪族炭化水素基(例えば C_2H_5 等)を表し、 R^4 は炭素数1~20の脂肪族炭化水素基(例えば CH_3 等)を表し、

aは3~30の整数を表し、bは15~30の整数を表す。)

斯かる親水性ポリエーテル変成シリコンの市販品としては、例えば「L-7001」、「L-7600」、「L-7604」(以上、日本ユニカ社製)；「SH 3746」、「SH 3749」、「SH 3771」(以上、トーレ・シリコン社製)；「KF-351A」、「KF-352A」、「KF-353A」(以上、信越化学

特開昭63-264522(3)

工業社製) ; 等を挙げることができる。

本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物を構成する原液には、第3の必須成分として水(成分⑤)が含有される。水の原液における含有割合は、20～40重量%程度であることが好ましい。

本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物を構成する原液には、第4の必須成分としてアルコール(成分⑥)が含有される。アルコールの原液における含有割合は、25～40重量%程度であることが好ましい。斯かるアルコールとしては、エチルアルコール、イソプロピルアルコール等を好ましく用いることができる。また、アルコールと共に、補助溶剤として1,1,2-トリクロロトリフルオロエタン(フロン113)等を用いることもできる。なお、フロン113は噴射剤としての機能をも有するものである。

また、本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物を構成する原液には、その他必要に応じて種々の添加剤が含有されていてもよい。斯かる添加剤としては、例えばサリチル酸グリコール、d, l-

カンファ、サリチル酸メチル、カンタスチンキ、トウガラシチンキ、イクタモールベンダザック等を挙げることができる。

前記原液と共に本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物を構成する噴射剤としては、例えばジメチルエーテル(DME)、液化石油ガス(LPG)、ジクロロジフルオロメタン(フロン12)、1,2-ジクロロテトラフルオロエタン(フロン114)、モノクロロジフルオロメタン(フロン22)、1,1,2-トリクロロトリフルオロエタン(フロン113)、1-クロロ-1,1-ジフルオロエタン(フロン142b)、1,1-ジフルオロエタン(フロン152a)等を用いることができ、また圧縮ガスも併用することができる。これらは単独で用いてもよいし、混合して用いてもよい。なお、フロン152aは、補助溶剤としての機能をも有するものである。

本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物において、原液と噴射剤の混合割合は、重量比で20:80～60:40の範囲であることが好ましい。

以上のようにして得られる本発明の消炎鎮痛剤

用エアゾール組成物は、通常は、エアゾール組成物の充填用容器内に充填されて使用に供される。

(具体的実施例)

以下、本発明の具体的実施例について説明するが、本発明がこれらの実施例に限定されるものではない。

<実施例1～7および比較例1～2>

後記第1表に示す処方に従って、消炎鎮痛剤用エアゾール組成物を調製した。

これらの組成物について、刺激臭の有無、薬効成分の人体の皮膚に対する付着性の良否を調べた。結果を後記第1表に併せて示す。

第 1 表

*数値は重量部を表す。

		+数値は重量比を表す。									
		実施例 1	実施例 2	実施例 3	実施例 4	実施例 5	実施例 6	実施例 7	比較例 1	比較例 2	
原	成分①	1,3-メントキシプロパン-1,2-ジオール	1.60	3.00	2.50	2.00	0.40	2.30	3.00	—	3.00
		1-メントール (比較用)	—	—	—	—	—	—	—	3.00	—
	成分②	ポリエーテル変成シリコン「SH3746」	1.60	—	—	—	—	—	—	0.50	—
		ポリエーテル変成シリコン「SH3749」	—	4.10	—	—	—	—	—	—	—
		ポリエーテル変成シリコン「KF-351A」	—	—	3.50	—	—	—	—	—	—
		ポリエーテル変成シリコン「KF-352A」	—	—	—	3.00	—	—	3.00	—	—
		ポリエーテル変成シリコン「L-7001」	—	—	—	—	0.20	—	—	—	—
		ポリエーテル変成シリコン「L-7600」	—	—	—	—	—	1.50	—	—	—
	成分③	エチルアルコール	25.00	19.50	11.48	20.00	4.25	14.60	12.00	11.00	7.98
	成分④	水	31.00	17.02	17.00	24.00	35.05	30.07	9.00	17.00	2.00
	その他	フロン113	—	—	—	—	30.00	—	30.98	—	—
		サルチル酸グリコール	0.20	2.00	2.00	1.50	—	—	2.00	2.00	2.00
サルチル酸メチル		1.10	2.58	2.00	1.50	—	—	2.00	2.00	2.00	
d,l-カンファ		1.60	3.10	2.50	2.00	0.10	1.50	3.00	3.00	3.00	
カンタスチンキ		0.02	—	0.02	—	—	0.03	0.02	0.02	0.02	
噴 射 剤	ジメチルエーテル (DME)	12.50	12.00	12.00	12.00	—	10.00	10.00	12.00	10.00	
	液化石油ガス (LPG)	6.25	9.80	8.00	7.00	—	30.00	25.00	9.00	10.00	
	フロン142b	—	—	15.00	5.00	—	—	—	—	—	
	フロン12	12.00	—	—	—	—	—	—	12.00	30.00	
	フロン114	6.93	26.60	24.00	7.00	—	—	—	28.48	30.00	
	フロン152a	—	—	—	15.00	—	—	—	—	—	
	フロン22	—	—	—	—	30.00	10.00	—	—	—	
	炭酸ガス (CO ₂)	0.20	0.30	—	—	—	—	—	—	—	
原液と噴射剤の配合重量比 (上段：原液，下段：噴射剤)		62.12 37.88	51.30 48.70	41.00 59.00	54.00 46.00	70.00 30.00	50.00 50.00	65.00 35.00	38.52 61.48	20.00 80.00	
評 価	刺激臭	なし	なし	なし	なし	なし	なし	なし	あり	なし	
	薬効成分の人体の皮膚に対する付着性	良好	良好	良好	良好	良好	良好	良好	良好	不良	

以上の実施例の結果から理解されるように、本発明の消炎鎮痛剤用エアゾール組成物は、刺激臭がなく快適に使用することができ、しかも薬効成分の人体の皮膚に対する付着性が良好である。

これに対して、比較例1の組成物は、1-メントールよりなる薬効成分を用いているため、刺激臭があって、人体の鼻、のど、目等を刺激し、不快感を与える問題点がある。

また、比較例2の組成物は、親水性ポリエーテル変成シリコンよりなる付着性向上剤を含有していないため、薬効成分の人体の皮膚に対する付着性が悪く、消炎鎮痛効果の低いものであった。

代理人 弁理士 大 井 正 彦

